

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

PAT-NO: JP401186811A

DOCUMENT-IDENTIFIER: JP 01186811 A

TITLE: SKIN BEAUTIFYING  
COSMETIC

PUBN-DATE: July 26, 1989

INVENTOR-INFORMATION:

NAME

ANDO, HIDEYA

HASHIMOTO, AKIRA

SHIMIZU, MITSUAKI

KATO, HISATOYO

OZASA, YOSHIJI

ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME

SUNSTAR INC

COUNTRY

N/A

APPL-NO: JP63011585

APPL-DATE: January 20, 1988

INT-CL (IPC): A61K007/00

ABSTRACT:

PURPOSE: To obtain a skin beautifying cosmetic exhibiting excellent synergistic effect on the elimination or prevention of melanism or pigmentation of skin with ultraviolet ray, by compounding a specific unsaturated fatty acid (derivative) and ascorbic acid, extract of placenta, kojic acid, etc.

CONSTITUTION: The cosmetic contains (A) a compound selected from a  $C_{18-22}$  fatty acid containing  $\geq 2$  unsaturated bonds in a molecular structure (e.g. linoleic acid or eicosapentaenoic acid), its salt and its ester with monohydric or dihydric alcohol and (B) a

compound selected from ascorbic acid (derivative), placenta extract, kojic acid (derivative), glucosamine (derivative), azelaic acid (derivative), retinol (derivative), pyridoxine (derivative), pantothenic acid (derivative), tranexamic acid (derivative), arbutin, photo-sensitizer, sulfur, tocopherol (derivative), etc. The amounts of the components A and B in the whole cosmetic are  $0.1 \sim 10$  wt.% and  $0.1 \sim 10$  wt.%, respectively.

COPYRIGHT: (C)1989,JPO&Japio

DERWENT-ACC-NO: 1989-258961

DERWENT-WEEK: 199726

COPYRIGHT 1999 DERWENT INFORMATION  
LTD

TITLE: Cosmetic material giving  
whitening effect to skin -  
contains mixt. of specified fatty acid  
derivs. any one or  
more of ascorbic acid, placenta extract,  
kojic acid,  
glucosamine etc.

PATENT-ASSIGNEE: SUNSTAR KK[SUNZ]

PRIORITY-DATA: 1988JP-0011585 (January 20,  
1988)

PATENT-FAMILY:

PUB-NO	PUB-DATE	
LANGUAGE	PAGES	MAIN-IPC
JP 01186811 A	July 26, 1989	N/A

006 N/A  
JP 2614474 B2 May 28, 1997 N/A  
006 A61K 007/48

APPLICATION-DATA:

PUB-NO	APPL-DESCRIPTOR
APPL-NO	APPL-DATE
JP 01186811A	N/A
1988JP-0011585	January 20, 1988
JP 2614474B2	N/A
1988JP-0011585	January 20, 1988
JP 2614474B2	Previous Publ. JP 1186811
N/A	

INT-CL (IPC): A61K007/00, A61K007/48

ABSTRACTED-PUB-NO: JP 01186811A

BASIC-ABSTRACT:

A new whitening cosmetic material contains (A) 18-22C free fatty acids having at least two unsatd. and their salts and esters with nono- and dihydric alcohols; and (B) one or or more of ascorbic acid and

its derivs, placenta  
extract, kojic acid and its derivs., glucosamine and its  
derivs., azelaic acid  
and its derivs., retinol and its derivs., pyridoxine  
and its derivs.,  
tranexamic acid and its derivs., arbutin,  
photosensitive elements, sulphur,  
tocopherol and its derivs., chondroitin sodium  
sulphate, 4-hydroxy-cinnamic  
acid, and carrot extract.

USE - For providing a cosmetic which effectively  
prevents the darkening of the  
skin and pigment deposition by UV light.

CHOSEN-DRAWING: Dwg.0/0

DERWENT-CLASS: D21 E19

CPI-CODES: D08-B09A; D09-E; E06-A01;  
E07-A02B; E07-A02F; E07-A02H; E07-D04C;  
E10-C02D; E10-C03; E10-C04L; E10-E04K;  
E10-E04M1; E10-G02G;

----- KWIC -----

Document Identifier - DID (1):  
JP 01186811 A



⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

平1-186811

⑬ Int. Cl.<sup>4</sup>

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 平成1年(1989)7月26日

A 61 K 7/00

X-7306-4C

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全6頁)

⑮ 発明の名称 美白化粧品

⑯ 特 願 昭63-11585

⑰ 出 願 昭63(1988)1月20日

⑱ 発 明 者	安 藤 秀 哉	京都府八幡市男山香呂 6 番地
⑱ 発 明 者	橋 本 晃	大阪府高槻市牧田町14-86-307
⑱ 発 明 者	清 水 満 章	京都府京都市中京区西ノ京北円町14-2
⑱ 発 明 者	加 藤 久 豊	大阪府高槻市上土室 2 丁目10-1
⑱ 発 明 者	小 笹 祥 次	滋賀県大津市比叡平 2 丁目37-12
⑰ 出 願 人	サンスター株式会社	大阪府高槻市朝日町 3 番 1 号
⑰ 代 理 人	弁理士 森 岡 博	

#### 明 細 書

##### 1. 発明の名称

美白化粧品

##### 2. 特許請求の範囲

(1) (a) 炭素数18~22かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸、その塩、あるいは一価または二価アルコールとのエステル、  
(b) アスコルビン酸及びその誘導体、胎盤抽出物、コウジ酸及びその誘導体、グルコサミン及びその誘導体、アゼライン酸及びその誘導体、レチノール及びその誘導体、ピリドキシン及びその誘導体、パントテン酸及びその誘導体、トラネキサム酸及びその誘導体、アルブチン、感光素、イオウ、トコフェロール及びその誘導体、コンドロイチン硫酸ナトリウム、4-ヒドロキシケイ皮酸、並びにニンジンエキスからなる群より選ばれた1種または2種以上の成分を配合したことを特徴とする美白化粧品。

##### 3. 発明の詳細な説明

###### 産業上の利用分野

本発明は、紫外線による皮膚の黒化あるいはシミ、ソバカスなどの皮膚の色素沈着を消失、淡色化もしくは予防する美白化粧品に関する。

###### 従来の技術および課題

従来、美白化粧品組成物としてはビタミンCおよびその誘導体、あるいは還元剤、胎盤エキスなどのチロジナーゼ活性阻害剤を配合したものが知られている。しかしながら、これら従来の美白化粧品は培養細胞による in vitro の実験ではメラニン産生抑制作用などを示すものの、実際に皮膚に適用した場合、十分な色素沈着の消失もしくは淡色化などの効果は得られていない。

本発明は実際に皮膚に適用した場合、副作用がなく優れた美白効果を示しうる化粧料を提供することを目的とする。

###### 課題を解決するための手段

本発明者らは、前記目的を達成すべく鋭意研究を重ねた結果、特定の脂肪酸またはその誘導体にさらに各種の成分を組み合わせるにより皮膚の色素沈着の消失、もしくは淡色化に優れた相乗

的な効果があらわれることを見だし、本発明を完成するに至った。

すなわち本発明は、(a)炭素数18~22かつ分子 造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸、その塩、あるいは一価または二価アルコールとのエステル、(b)アスコルビン酸及びその誘導体、胎盤抽出物、コウジ酸及びその誘導体、グルコサミン及びその誘導体、アゼライン酸及びその誘導体、レチノール及びその誘導体、ピリドキシン及びその誘導体、パントテン酸及びその誘導体、トラネキサム酸及びその誘導体、アルブチン、感光素、イオウ、トコフェロール及びその誘導体、コンドロイチン硫酸ナトリウム、4-ヒドロキシケイ皮酸、並びにニンジンエキスをからなる群より選ばれた1種または2種以上の成分を配合したことを特徴とする美白化粧料を提供するものである。

本発明組成物に配合されるリノール酸、γ-リノレン酸など炭素数18~22を有し、かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の脂肪酸は、植物油および動物油脂に含まれている。しかし、こ

うム塩、カリウム塩などの金属塩、アルギニン塩、リジン塩などのアミノ酸塩、トリエタノールアミン塩、モノエタノールアミン塩等のアミン塩などが挙げられる。

さらに、前記遊離脂肪酸のアルキルエステルとしては、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどの一価アルコールとのエステル、エチレングリコール、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコールなどの二価のアルコールとのエステルなどが挙げられる。

これら遊離脂肪酸、塩、またはエステルの化粧料中における配合量は、0.1~10重量%であるのが好ましい。かかる配合量が、0.1重量%未満であると、色素沈着の淡色化効果がなく、一方、10重量%を越えると、皮膚に対して刺激性を示すようになる。

一方、前記脂肪酸等と共に本発明組成物に配合される成分は、アスコルビン酸及びその塩あるいはエステル、胎盤抽出物、コウジ酸及びその塩あるいはエステル、グルコサミン及びその塩あるいは

それら脂肪酸は遊離の状態で存在することは少なく、そのほとんどはトリグリセリドの状態で存在する。このようなトリグリセリドは、遊離の脂肪酸もしくはそのアルキルエステルのごとく動物試験等において優れた色素沈着淡色化作用は認められない。また、パルミチン酸、ステアリン酸などの飽和脂肪酸にあっても同様に色素沈着抑制効果は認められず、場合によっては逆にメラニン産生を亢進する。かかる飽和脂肪酸は、植物油および動物油脂に多量にふくまれているため、本発明化粧料におけるリノール酸などの配合にあたっては精製したものをを用いることが好ましい。

本発明の美白化粧料に配合される炭素数18~22かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸の代表的なものとしては、リノール酸、リノエライジン酸、α-リノレン酸、γ-リノレン酸、ジホモγ-リノレン酸、アラキドン酸、エイコサペンタエン酸などが挙げられ、これらの1種または2種以上が用いられる。

また、これら遊離脂肪酸の塩としては、ナトリ

ウム塩、カリウム塩などの金属塩、アルギニン塩、リジン塩などのアミノ酸塩、トリエタノールアミン塩、モノエタノールアミン塩等のアミン塩などが挙げられる。はエステル、アゼライン酸及びその塩あるいはエステル、レチノール及びそのエステル、ピリドキシン及びその塩あるいはエステル、パントテン酸及びその塩あるいはエステル、トラネキサム酸及びその塩あるいはエステル、アルブチン、感光素、イオウ、トコフェロール及びその脂肪酸エステル、コンドロイチン硫酸ナトリウム、4-ヒドロキシケイ皮酸、並びにニンジンエキスである。これらの1種または2種以上が配合される。これら成分の化粧料組成物中における配合量は0.1~10重量%であるのが好ましい。かかる配合量が0.1重量%未満であると、色素沈着の淡色化効果がなく、一方、10重量%を越えると刺激性が強く、使用上好ましくない。

これらの活性成分と前記脂肪酸類との併用により皮膚に対し相乗的な美白効果を示すことについては従来知られていない。

つぎに各種活性成分についてその色素沈着の消失もしくは淡色化の作用を評価した結果を示す。

## 試験方法:

English 系茶色モルモットの背部を剃毛して紫外線(UVB強度:  $1\text{ J/cm}^2$ )を照射し、1週間後に色素沈着を得た。つぎに、この部位にリノール酸をはじめとする脂肪酸、あるいは他の成分をエタノールに溶解した検体を4週間累積塗布した。色素沈着の淡色化を評価する方法として、検体を塗布していない部位(無塗布)の色素沈着度を0とし、その淡色化の度合いにより、以下に示す判定基準に従い、色素沈着度を肉眼判定した。

## 判定基準:

- 0 色素沈着の淡色化が認められない
- 1 わずかに色素沈着の淡色化が認められる
- 2 中等度の色素沈着の淡色化が認められる
- 3 顕著な色素沈着の淡色化が認められる

結果を次の第1表に示す。

第1表

成分	配合量(重量%)															
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16
リノール酸	0.5										0.5					
リノール酸イソマー	0.5											0.5				
γ-リノレン酸			0.5										0.5			
ジホモγ-リノレン酸				0.5												
アラキドン酸					0.5											
α-リノレン酸						0.5								0.5		
エイコサペンタエン酸							0.5								0.5	
ドコサヘキサエン酸								0.5								0.5
リノール酸エチル									0.5							
リノール酸トリウム										0.5						
アスコルビン酸	0.5															
7,8-ジヒドロリノレン酸	0.5															
脂肪酸抽出物											0.5					
コウジ酸			0.5													
アルコサミン					0.5											
アゼライン酸				0.5												
レチノール						0.1										
酢酸レチノール							0.1									
ビリドキシン								0.1								
遊離ビリドキシン									0.1							
パントテン酸										0.5						
トラネキサム酸											0.5					
アルブチン												0.5				
紫外線													0.5			
イオウ														0.5		
トコフェロール															0.5	
2,2'-アジビス(4-メチル-6-tert-ブチル-4H-ベンゾ[1,2-b]ピリジン-3-カルボン酸)																0.5
ニンジンエキス																
エチルアルコール	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75
80%グリセリン(10%酸化甘油)	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
精製水	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75	75
効果	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-3

第1表 (つづき)

成分	配合量 (重量%)															
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16
リノール酸																
リノエライジン酸		0.5														
γ-リノレン酸			0.5													
ジホモ-γ-リノレン酸				0.5												
アラキドン酸																
α-リノレン酸					0.5											
エイコサペンタエン酸																
ドコサヘキサエン酸						0.5										
リノール酸エチル							0.5									
リノール酸ナトリウム								0.5								
アスコルビン酸									0.5							
7-OH-アスコルビン酸										0.5						
松葉抽出物											0.5					
コウジ酸												0.5				
グルコサミン										0.5						
アゼライン酸											0.5					
レチノール												0.1				
酢酸レチノール													0.1			
ビリドキシン														0.5		
塩化ビリドキシン															0.5	
パントテン酸																0.5
トラネキサミン酸																0.5
アルブチン																0.5
紫外線吸収剤																0.5
イオウ																0.5
トコフェロール																0.5
カハチン(80%)																0.5
ニンジンエキス																0.5
エチルアルコール																0.5
約44%の(40%)酸化ビタミン油																0.5
精製水																0.5
効果																0.5

第1表より明らかなごとく、アスコルビン酸などの活性成分単独では色素沈着の淡色化は認められず、また炭素数18~22かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸、その塩あるいはアルキルエステルを単独で配合した場合も、色素沈着の淡色化はわずかである。これらに対して、遊離脂肪酸、その塩あるいはエステルとアスコルビン酸などの成分を併用した場合は、顕著な色素沈着の淡色化が認められる。

本発明の美白化粧料は、公知の方法により、化粧水、化粧用油、クリーム、乳液、パック、パウダーなどの形態に製造される。

さらに本発明の化粧料には、その種類に応じ性能を損なわない範囲において、適宜公知の成分を配合することができる。

なお、従来から使用されている紫外線吸収剤、紫外線散乱剤、抗炎症剤、抗酸化剤などを配合しても良い。

#### 実施例

つぎに本発明を実施例によりさらに具体的に説

明する。

#### 実施例1 (化粧水)

成分	配合量 (重量%)
アスコルビン酸リン酸マグネシウム塩	0.5
リノール酸	0.5
α-リノレン酸	0.5
グリセリン	6.0
エタノール	8.0
ポリオキシエチレン(80%)酸化ビタミン油	0.8
パラオキシ安息香酸メチル	0.05
クエン酸	0.05
クエン酸ナトリウム	0.07
香料	0.1
水溶性プラセンタエキス	2.0
精製水	残部

精製水にグリセリン、クエン酸、クエン酸ナトリウム、水溶性プラセンタエキスを溶解する。別にエタノールにアスコルビン酸リン酸マグネシ

ウム塩、リノール酸、 $\alpha$ -リノレン酸、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油(60E.O.)、メチルパラベン、香料を溶解し、前記の精製水溶液に加え、可溶化し、ろ過して化粧水を得た。

## 実施例2(化粧用油)

成 分	配合量(重量%)
トコフェロール	0.2
4-ヒドロキシケイ皮酸	0.2
リノール酸エチル	1.0
エイコサペンタエン酸	1.0
パルミチン酸アスコルビル	0.2
酢酸レチノール	0.3
リノール酸コレステリル	1.0
月見草油	2.0
スクワラン	残部

スクワランに他の成分を均一に溶解して化粧用油を得た。

## 成分(B)

パラオキシ安息香酸メチル	0.2
プロピレングリコール	5.0
香料	0.2
精製水	残部

成分(A)を加熱溶解し、80℃に保持する。別に香料を除く成分(B)を加熱溶解して80℃に保ち、これに前記成分(A)を攪拌しながら加え、充分混合する。さらに攪拌しながら冷却を行い、香料を加え、さらに冷却してクリームを得た。

## 実施例4(乳液)

成 分	配合量(重量%)
<u>成分(A)</u>	
アゼライン酸	0.2
ピリドキシン	0.2
リノール酸イソプロピル	2.0
グリチルレチン酸ステアリル	0.1
流動パラフィン	5.0
ワセリン	2.0

## 実施例3(クリーム)

成 分	配合量(重量%)
<u>成分(A)</u>	
アルブチン	0.2
ニンジンエキス	0.2
$\gamma$ -リノレン酸	2.0
リノール酸エチル	1.0
ステアリン酸アスコルビル	1.0
サラシミツロウ	4.0
セタノール	2.0
ステアリン酸	1.0
ミリスチン酸イソプロピル	5.0
ラノリン	2.0
流動パラフィン	9.0
自己乳化型モノステアリン酸グリセリル	3.0
モノステアリン酸	
ポリオキシエチレンソルビタン(20E.O.)	1.5
パラオキシ安息香酸プロピル	0.1

ミツロウ	1.0
セスキオレイン酸ソルビタン	2.0

## 成分(B)

ポリオキシエチレン オレイルエーテル(20E.O.)	2.5
パラオキシ安息香酸エチル	0.2
プロピレングリコール	5.0
カルボキシビニルポリマー	0.5
水酸化カリウム	0.5
香料	0.2
精製水	残部

成分(A)を80℃にて加熱溶解し、別に加温(80℃)溶解した香料を除く成分(B)に攪拌しながら加え、充分混合する。ついで、攪拌しながら冷却を行い、香料を加え、さらに冷却して乳液を得た。

## 実施例5(パック)

成 分	配合量(重量%)
コンドロイチン硫酸ナトリウム	0.5

$\alpha$ -リノレン酸	3.0
水溶性ブラセンタエキス	2.0
酢酸ビニル・スチレン共重合体	10.0
ポリビニルアルコール	10.0
ソルビット	6.0
酸化チタン	8.0
カオリン	7.0
エタノール	5.0
香料	2.0
パラオキシ安息香酸エチル	0.2
精製水	残部

コンドロイチン硫酸ナトリウム、 $\alpha$ -リノレン酸、香料およびエタノールを均一に溶解する。これを酢酸ビニル・スチレン共重合体、ポリビニルアルコール、ソルビット、酸化チタンおよびカオリンを均一に混和したものに加える。これに、さらに水溶性ブラセンタエキス、パラオキシ安息香酸エチルを精製水に均一に溶解した溶液を加え、均一に混和しパックスを得た。

## 実施例6(パウダー)

成 分	配合量(重量%)
トラネキサム酸	0.1
イオウ	0.1
リノエライジン酸	2.0
デキストリン	94.8
タルク	2.0
ステアリン酸デカグリセリル	1.0

トラネキサム酸、イオウ、リノエライジン酸およびステアリン酸デカグリセリルを加熱溶解し、70℃に保持し、これをデキストリンおよびタルクの混合物に攪拌しながら徐々に加えてパウダーを得た。

## 発明の効果

本発明化粧料は、皮膚に適用することにより、紫外線による皮膚の黒化あるいは色素沈着を消失、淡色化もしくは予防し優れた美白効果を発揮する。